

Requested Patent: JP55124763A

Title:

TRIFLUOROMETHYL-2-PYRIDINONE OR PYRIDINTHIONE COMPOUNDS AND  
PROCESS FOR THE PREPARATION OF THE SAME ;

Abstracted Patent: US4546191 ;

Publication Date: 1985-10-08 ;

Inventor(s):

NISHIYAMA RYUZO (JP); FUJIKAWA KANICHI (JP); YOKOMICHI ISAO (JP); HAGA  
TAKAHIRO (JP); NAGATANI KUNIAKI (JP); HAYASHI KOUJI (JP) ;

Applicant(s): ISHIHARA MINING \_CHEMICAL CO (JP) ;

Application Number: US19800131719 19800319 ;

Priority Number(s): JP19790032068 19790319 ;

IPC Classification: ;

Equivalents:

BE882284, CA1134833, CH642355, DE3008908, FR2451917, GB2049666,  
IT1147077, JP1502415C, JP63048865B, NL8001618 ;

ABSTRACT:

A trifluoromethyl-2-(thio)pyridone compound having the formula: wherein X represents a hydrogen atom or a halogen atom, Y1 and Y2 each represents a hydrogen atom, a halogen atom or a trifluoromethyl group, and Z represents an oxygen atom or a sulfur atom, in which either Y1 or Y2 represents a trifluoromethyl group, and when X and Y2, or X and Y1 represent a hydrogen atom at the same time, then Z represents a sulfur atom, and a process for preparing the same.

## ⑫ 公開特許公報 (A)

昭55—124763

⑤Int. Cl.<sup>3</sup>  
C 07 D 213/64  
213/70識別記号 庁内整理番号  
7138—4C  
7138—4C

⑬公開 昭和55年(1980)9月26日

発明の数 1  
審査請求 未請求

(全 3 頁)

⑭5—トリフルオロメチル—2—ピリドン誘導体

⑯発明者 芳賀隆弘

草津市野村町221番地

⑰特 願 昭54—32068

⑯発明者 長谷邦昭

⑱出 願 昭54(1979)3月19日

守山市浮気町321番地の31

⑲発明者 西山隆三

⑯発明者 林弘仁

高槻市真上町5丁目41番22号

守山市浮気町321番地の31

⑲発明者 藤川敢一

⑰出願人 石原産業株式会社

守山市浮気町321番地の31

大阪市西区江戸堀1丁目3番11号

⑲発明者 横道勲

草津市野村町221番地

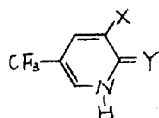
## 明 細 書

## 1. 発明の名称 5—トリフルオロメチル—2—

ピリドン誘導体

## 2. 特許請求の範囲

## 1. 一般式

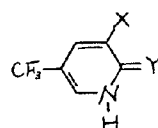


(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5—トリフルオロメチル—2—ピリドン誘導体。

## 3. 発明の詳細な説明

本発明は医薬、農薬、染料などの中間原料として有用で、新規な5—トリフルオロメチル—2—ピリドン誘導体に関する。

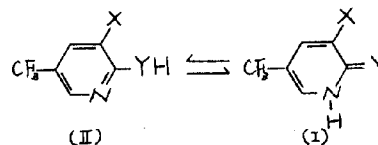
詳しくは本発明は一般式



(I)

(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5—トリフルオロメチル—2—ピリドン誘導体である。

前記一般式(I)の5—トリフルオロメチル—2—ピリドン誘導体は、次に示すような互変異性として存在することができる。



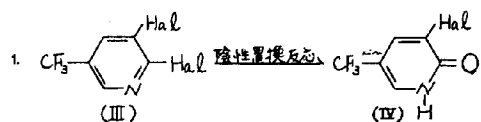
(II)

(I)

(式中X及びYは前述の通りである)

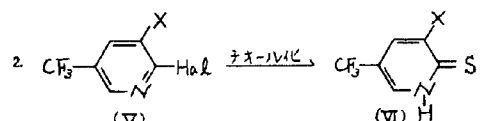
前記一般式(I)において、Xで表わされるハロゲン原子としては弗素、塩素、臭素、沃素が挙げられる。

本発明の5-トリフルオロメチル-2-ビリドン誘導体は通常、例えば下記方法によって製造される。



(上記反応式中 Hal はハロゲン原子である)

一般に上記反応はジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドなどの非プロトン性極性溶媒中、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどのアルカリ水溶液を用いて50～150℃、0.1～10時間で行なわれる。



(上記反応式中 X 及び Hal は前述の通りである)

一般に上記反応はメタノール、エタノールなどのアルコール類、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドなどの非プロトン性極性溶

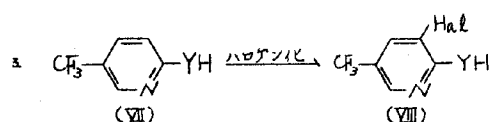
- 3 -

媒とを反応させることによりN-ベンゾイル-N'-[4-(5-トリフルオロメチルビリジン-2-イルオキシ)フェニル]ウレア系化合物に誘導できる。詳しくは本発明化合物の3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ビリドンと3,4,5-トリクロロニトロベンゼンとを縮合、還元して3,5-ジクロロ-4-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルビリジン-2-イルオキシ)アニリンを得、更にこのものと2,6-ジフルオロベンゾイルイソシアネートとを反応させると、N-(2,6-ジフルオロベンゾイル)-N'-[3,5-ジクロロ-4-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルビリジン-2-イルオキシ)フェニル]ウレアを得ることができる。このものは殺虫剤の有効成分として優れた活性を示し、種々の有害虫、特に有害昆虫の防除に有効であって、例えばこの化合物<sup>9</sup>100 ppm水分散液にキャベツの葉片を浸漬し、それを風乾してそこへ2～3令のコナガの幼虫を放ち、8日目に生死を判定した結果、100%の

- 5 -

特開昭55-124763(2)

媒などの溶媒中、チオ尿素、硫化ソーダ、チオ硫酸ソーダ、N,N-ジメチルジチオカルバミン酸ソーダなどのチオール化剤を用いて50～還流温度0.5～10時間で行なわれる。



(上記反応式中 Y 及び Hal は前述の通りである)

一般に上記反応は四塩化炭素、クロロホルム、酢酸、二硫化炭素、水、非プロトン性極性溶媒などの溶媒中、塩素ガス、臭素、チオニルクロライド、スルフリルクロライドなどのハロゲン化剤を用いて0～100℃、0.5～10時間で行なわれる。

本発明化合物は、例えばハロゲン化ニトロベンゼン類と縮合させて4-(5-トリフルオロメチルビリジン-2-イルオキシ)ニトロベンゼン類を生成させ、これを還元して得られる4-(5-トリフルオロメチルビリジン-2-イルオキシ)アニリン類とベンゾイルイソシアネ

- 4 -

死虫率が得られた。

次に本発明化合物の具体的合成例を記載する。

合成例1. 3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ビリドン

(A)

5-トリフルオロメチル-2-ビリドン0.2gをクロロホルム20mlに溶解させ、50℃に加温して塩素ガスを1時間攪拌下に通じた。反応終了後、クロロホルムを留去し、トルエン-n-ヘキサンの混合溶媒で再結晶して融点144～147℃の目的物0.15gを得た。

(B)

水酸化ナトリウム2.4gを水12.5mlに溶解させた水溶液に2,3-ジクロロ-5-トリフルオロメチルビリジン4gを加え、更にジメチルスルホキシド12.5mlを加えて加熱し、110℃で1時間攪拌下に反応させた。反応終了後生成物を放冷し、濃塩酸で酸性にして沈殿物を得、このものを濾過して目的物2.5

- 6 -

gを得た。

合成例 2 5-トリフルオロメチル-2-チオ  
ビリドン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルビリ  
ジン 4 g とチオ尿素 1.67 g とをエタノール  
30 ml に溶解させ、加熱して還流状態で3時  
間攪拌下に反応させた。その後、水酸化カリ  
ウム水溶液 1.23 g を徐々に加えて還流状態  
で1時間反応させた。反応終了後、生成物を  
放冷し、希アルカリ水溶液中に投入して塩化  
メチレンで洗浄し、酢酸で酸性にした。次い  
で、塩化メチレンで抽出し、抽出層を水洗後  
無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、塩化メチレ  
ンを留去して融点 147~150℃の目的物  
2.1 g を得た。

合成例 3 3-ブロモ-5-トリフルオロメチ  
ル-2-ビリドン

5-トリフルオロメチル-2-ビリドン 0.  
4 g を酢酸 10 ml に溶解させ、そこへ臭素 0.  
4 g を加えて攪拌下で4時間反応させた。反

応終了後、酢酸を留去し、塩化メチレン-n  
-ヘキサンの混合溶媒で再結晶して融点 162  
~165℃の目的物 0.45 g を得た。

合成例 4 3-クロロ-5-トリフルオロメチ  
ル-2-チオビリドン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルビリ  
ジン 4 g に代えて2,3-ジクロロ-5-トリ  
フルオロメチルビリジン 4.75 g を用いる以  
外は前記合成例 2 と同様にして反応を行ない、  
後処理を行なって融点 125~128℃の目  
的物 1.9 g を得た。

特許出願人 石原産業株式会社